

Érvényesség: **1984.01.01 - 1989.12.31**

Bejelentés ügyszám:	P8001690	Bejelentés napja:	19800707
Közzétételi szám:	30687	Közzététel napja:	19840328
Lajstromszám:	184797	Megadás meghírdetése:	19841029
Elsőbbségi adatok:	US055728 - 19790709, US142903 - 19800423		
NSZO:	G17/012-9/84		

Magyar cím:

Eljárás kinazolin származékok előállítására

Angol cím:

PROCESS FOR PREPARING QUINAZOLINE DERIVATIVES

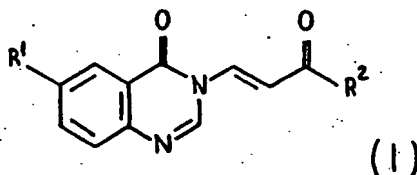
Bejelentő:

F. Hoffmann-La Roche et Co. Ag., Bazel, CH

Feltaláló:

LeMahieu, Ronald Andrew, North, Caldwell, N. J., US

Nason, William Chester, Mountain Lakes, N. J., US



Kivonat:

A találmány tárgya eljárás (I) általános képletű transz-3-(4-oxo-4H-kinazolin-3-il)-propénsav-származékok (mely képletben

R1 jelentése kis szénatomszámú alkil-, 3-5 szénatomos cikloalkil-, kis szénatomszámú alkoxi- vagy hidroxilcsoport, halogénatom, kis szénatomszámú alkiltio-, kis szénatomszámú alkil-szulfonil-, kis szénatomszámú alkil-szulfonil-csoport, egy di-(C1-4)-alkil-N(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-O- általános képletű csoport, hidroxi-(kis szénatomszámú)-alkoxi- vagy trifluor-metil-csoport;

R2 jelentése hidroxil-, kis szénatomszámú alkoxi-, egy di-(C1-4)-alkil-N(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-O- általános képletű csoport vagy egy di-(C1-4)-alkil-N(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-NH- általános képletű csoport és

n jelentése 2-4-ig terjedő egész szám) és gyógyászatiilag alkalmas sóik előállítására.

Az (I) általános képletű vegyületeket a megfelelő, a 3-helyzetben helyettesítetlen 4-oxo-4H-kinazolin-származékok és 3-klór-akrilsav-származékok reakciójával állíthatjuk elő.

Az (I) általános képletű új vegyületek a gyógyászatban allergia-ellenes hatásuk révén alkalmazhatók.

B  
S&K  
G

- 2 -

**Abstract:**

The present invention relates to a process for the preparation of trans-3-(4-oxo-4H-quinazolin-3-yl)-propenic acid derivatives of the general formula (I) wherein

$R^1$  is lower alkyl,  $C_3$ - $C_5$  cycloalkyl, lower alkoxy, hydroxy, halo, lower alkylthio, lower alkylsulphynyl, lower alkylsulphonyl, a group of the general formula  $di-(C_1-C_4 \text{ alkyl})-N(CH_2)_n-O-$ , hydroxy-(lower alkoxy) or trifluoromethyl;

$R^2$  is hydroxy, lower alkoxy, a group of the general formula  $di-(C_1-C_4 \text{ alkyl})-N(CH_2)_n-O-$  or  $di-(C_1-C_4 \text{ alkyl})-N(CH_2)_n-NH-$ ;

$n$  is an integer from 2 to 4

and their pharmaceutically acceptable salts.

The compounds of the general formula (I) can be prepared by reacting a corresponding 3-unsubstituted 4-oxo-4H quinazoline derivative with a 3-chloroacrylic acid derivative.

The compounds of the general formula (I) possess useful antiallergenic activity. "

Enclosed we are also sending you a copy of the abstract attached to the Hungarian search report as well as our Debit Note for the services.

We hope that the above information will be of help to you, however, should you need any additional information, please do not hesitate to contact us.

Very truly yours

  
Zolt Szentpéteri  
Patent Attorney

Encl.